

特 許 協 力 条 約

PCT

REC'D 28 OCT 2004

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)

[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 09571	今後の手続きについては、様式PCT/ IPEA/ 416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/09317	国際出願日 (日.月.年) 23.07.2003	優先日 (日.月.年) 23.07.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. ⁷ C07D213/22, 401/04, 405/04, 409/04, 413/04, 417/04		
出願人 (氏名又は名称) 株式会社クラレ		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 3 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a ☒ 附属書類は全部で 1 ページである。

☒ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)

☐ 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替用紙

b ☐ 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☐ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☐ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☐ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 13.01.2004	国際予備審査報告を作成した日 01.10.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 渡辺 仁	4P 8213
電話番号 03-3581-1101 内線 3490		

様式PCT/ IPEA/ 409 (表紙) (2004年1月)

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査

☐ PCT規則12.4にいう国際公開

☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☐ 出願時の国際出願書類

☒ 明細書

第 1-31 _____ ページ、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ*

第 _____ ページ*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☒ 請求の範囲

第 1-7 _____ 項、出願時に提出されたもの

第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 8 _____ 項*、06.05.2004 付けて国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ 項*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ/図*

第 _____ ページ/図*、 _____ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ

☐ 請求の範囲 第 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること)

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ

☐ 請求の範囲 第 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること)

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)

請求の範囲 1-8

請求の範囲

有

無

進歩性(IS)

請求の範囲

請求の範囲 1-8

有

無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲 1-8

請求の範囲

有

無

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1/US 5693611 A

文献2/US 6169184 B1

文献3/Tetrahedron, Vol. 58, No. 22, 20 May 2002, p. 4429-4438

文献4/JP 2000-80082 A

文献1は、本国際出願の明細書にも引用されている文献であって、5-ボロン酸-2-アルコキシピリジンとハロゲン化ピリジン化合物をパラジウム触媒を用いたカップリング反応に付し、5-アリール-2-アルコキシピリジン誘導体を製造する方法が記載されている。

文献2-3には、2-ベンゼンスルホニルピリジンやその誘導体を、有機マグネシウム化合物や有機亜鉛化合物と反応させることによるアリールクロスカップリング反応が記載されている。また、文献3には、触媒を用いない場合には、選択的にクロスカップリング反応が進行することが記載されている。

また、文献4には、2-アリールスルホニルピリジンと、アリール化剤とを反応させることによる2-置換ピリジン誘導体の製造方法が記載され、アリール化剤として、リチウム化合物が使用可能であることが記載されている。

請求の範囲1-8に記載された製造方法のように、2-ベンゼンスルホニルピリジン誘導体と第1族、第2族、第12族、第13族から選ばれる金属と複素環化合物からなる有機金属試薬とを反応させることによるアリールクロスカップリング反応は記載されていないから、請求の範囲1-8に記載された製造方法は、PCT第33条(2)に規定する新規性を有する。

しかし、遷移金属触媒を用いずにピリジン環の2-位にアリール置換基を導入する方法が文献2-4には記載されているから、これら文献の記載に基づき、ピリジン環の2-位にヘテロアリール置換基を導入する方法として、2-ベンゼンスルホニルピリジンやその誘導体を有機マグネシウム化合物や有機亜鉛化合物、あるいは有機リチウム化合物とを反応させる方法を採用してみることは、当業者が容易になし得ることである。したがって、請求の範囲1-8に記載された製造方法は、PCT第33条(3)に規定する進歩性を有していない。

化合物である請求項 3 に記載の製造方法。

5. 芳香族複素環がピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、ピラジン環、チオフェン環、フラン環、ピロール環、イミダゾール環、ピラゾール環、チアゾール環、オキサゾール環またはイソオキサゾール環である請求項 4 に記載の製造方法。

6. 一般式 (I I) において、M がリチウム原子、ナトリウム原子、カリウム原子、マグネシウム原子、カルシウム原子、亜鉛原子、ホウ素原子またはアルミニウム原子を表す有機金属化合物である請求項 3 ～ 5 のいずれかの項に記載の製造方法。

10 7. 一般式 (I I) において、M がリチウム原子またはマグネシウム原子を表す有機金属化合物である請求項 3 ～ 5 のいずれかの項に記載の製造方法。

8. (追加) 芳香族複素環がピリジン環である請求項 5 ～ 7 のいずれかの項に記載の製造方法。

15